

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
14. November 2002 (14.11.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 02/089757 A2

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: **A61K 7/40**, (74) Gemeinsamer Vertreter: **BEIERSDORF AG**; Unnastr. 48, 20245 Hamburg (DE).
7/48, 31/35

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/04624 (81) Bestimmungsstaaten (national): JP, US.

(22) Internationales Anmeldedatum: 26. April 2002 (26.04.2002) (84) Bestimmungsstaaten (regional): europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
101 22 342.0 9. Mai 2001 (09.05.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): **BEIERSDORF AG** [DE/DE]; Unnastr. 48, 20245 Hamburg (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **BIERGIESSER, Helga** [DE/DE]; Sandweg 16, 21465 Reinbek (DE). **GALLINAT, Stefan** [DE/DE]; Martin-Niemöller-Str. 13, 22880 Wedel (DE). **HERPENS, Andreas** [DE/DE]; Steinburger Str. 5B, 21465 Reinbek (DE). **VENZKE, Kirsten** [DE/DE]; Novalisweg 27, 22303 Reinbek (DE). **SCHÖNROCK, Uwe** [DE/DE]; Lerchenweg 33, 23866 Nahe (DE). **STÄB, Franz** [DE/DE]; Bäckerstra. 3, 21279 Echem (DE).

Erklärungen gemäß Regel 4.17:

- hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die folgenden Bestimmungsstaaten JP, europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR)
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US
- Erfindererklärung (Regel 4.17 Ziffer iv) nur für US

Veröffentlicht:

- ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: USE OF ISOFLAVONES IN COSMETIC OR DERMATOLOGICAL PREPARATIONS

(54) Bezeichnung: VERWENDUNG VON ISOFLAVONEN IN KOSMETISCHEN ODER DERMATOLOGISCHEN ZUBEREITUNGEN

(57) Abstract: The use of substances selected from the following group: ipriflavone (7 -isopropoxy-isoflavone), formononetin (7 -hydroxy-4'-methoxyisoflavone) ononin (formononetin-7-O-β-D-glucopyranoside) 4'-isopropyl-isoflavone, mono-hydroxy-isoflavone, mono-hydroxy-dihydro-isoflavone, mono-hydroxy- tetrahydro-isoflavone, O-desmethylangolensin, dihydro-daidzein (dihydro-7,4'- dihydroxy-isoflavone), tetrahydro-daidzein (tetrahydro- 7,4'-dihydroxy-isoflavone), dihydro-genistein (dihydro-5,7,4'- trihydroxy-isoflavone), 2-dehydro-O-desmethyl-angolensin, dehydroequol, 4-hydroxy-7-glucose-isoflavone and 5-hydroxy-7,4'-dimethoxy-isoflavone, in cosmetic or dermatological preparations in the treatment and prophylaxis of symptoms of inflammatory or itchy skin conditions in sensible skin and in modifications of DNS synthesis and/or DNS repair in skin.

(57) Zusammenfassung: Verwendung von Substanzen gewählt aus der Gruppe: Ipriflavin (7 -Isopropoxy-Isoflavon) , Formononetin (7 -Hydroxy-4'-Methoxyisoflavon) Ononin (Formononetin-7-O-β-D-Glucopyranosid) 4'-Isopropyl-Isoflavon, Mono-hydroxy-Isoflavone, Mono-hydroxy-Dihydro-Isoflavone Mono-hydroxy- Tetrahydro-Isoflavone, O-Desmethylangolensin, Dihydro-Daidzein (Dihydro-7,4'- Dihydroxy-Isoflavon) Tetrahydro-Daidzein (Tetrahydro- 7,4'-Dihydroxy-Isoflavon), Dihydro-Genistein (Dihydro-5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon), 2-Dehydro-O-Desmethyl-Angolensin, Dehydroequol, 4-Hydroxy-7-Glucose-Isoflavon und 5-Hydroxy-7,4'-Dimethoxy-Isoflavon in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung und Prophylaxe der Symptome von entzündlichen und oder juckenden Hautzuständen bei sensibler Haut sowie bei Veränderungen der DNS-Synthese und/oder DNS-Reparatur in der Haut.



WO 02/089757 A2

Beiersdorf Aktiengesellschaft
Hamburg

5

Beschreibung

Verwendung von Isoflavonen in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen

10

Die vorliegende Erfindung betrifft die Verwendung spezieller Isoflavonoide in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Prophylaxe vor und Behandlung von sensibler Haut, Juckreiz sowie von Veränderungen der DNS-Synthese- und/oder DNS-Reparaturleistung in der Haut.

15

Insbesondere betrifft die vorliegende Erfindung kosmetische Zubereitungen mit einem zusätzlichen, wirksamen Schutz vor schädlichen Oxidationsprozessen in der Haut, aber auch zum zusätzlichen Schutz kosmetischer Zubereitungen selbst bzw. zum zusätzlichen Schutz der Bestandteile kosmetischer Zubereitungen vor schädlichen Oxidations-

20

prozessen.

25

Unter kosmetischer Hautpflege ist in erster Linie zu verstehen, daß die natürliche Funktion der Haut als Barriere gegen Umwelteinflüsse (z. B. Schmutz, Chemikalien, Mikroorganismen) und gegen den Verlust von körpereigenen Stoffen (z. B. Wasser, natürliche Fette, Elektrolyte) gestärkt oder wiederhergestellt wird.

30

Wird diese Funktion gestört, kann es zu verstärkter Resorption toxischer oder allergener Stoffe oder zum Befall von Mikroorganismen und als Folge zu toxischen oder allergischen Hautreaktionen kommen.

Ziel der Hautpflege ist es ferner, den durch tägliche Waschen verursachten Fett- und Wasserverlust der Haut auszugleichen. Dies ist gerade dann wichtig, wenn das natürliche Regenerationsvermögen nicht ausreicht. Außerdem sollen Hautpflegeprodukte vor

Umwelteinflüssen, insbesondere vor Sonne und Wind, schützen und die Hautalterung verzögern.

5 Die chronologische Hautalterung wird z. B. durch endogene, genetisch determinierte Faktoren verursacht. In Epidermis und Dermis kommt es alterungsbedingt z. B. zu folgenden Strukturschäden und Funktionsstörungen, die auch unter den Begriff „Senile Xerosis“ fallen können:

- 10 a) Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen,
- b) Juckreiz und
- c) verminderte Rückfettung durch Talgdrüsen (z. B. nach Waschen).

Exogene Faktoren, wie UV-Licht und chemische Noxen, können kumulativ wirksam sein. In Epidermis und Dermis kommt es insbesondere durch exogene Faktoren z. B. zu folgenden Strukturschäden- und Funktionsstörungen in der Haut:

15

- d) vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit).

Produkte zur Pflege sensibler, juckender und/oder trockener Haut bzw. Produkte zur Behandlung von oder Prophylaxe vor DNS-Schädigungen sind an sich bekannt. Allerdings ist deren Wirksamkeit begrenzt.

20

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. Während Strahlen mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist (der sogenannte UVC-Bereich), von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert werden, verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UVB-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen.

25

Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

30

Zum Schutz gegen UVB-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoessäure, der Zimtsäure,

der Salicylsäure, des Benzophenons sowie auch des 2-Phenylbenzimidazols handelt.

Auch für den Bereich zwischen etwa 320 nm und etwa 400 nm, des sogenannten UVA-Bereich, ist es wichtig, Filtersubstanzen zur Verfügung zu haben, da dessen Strahlen
5 Reaktionen bei lichtempfindlicher Haut hervorrufen können. Es ist erwiesen, daß UVA-Strahlung zu einer Schädigung der elastischen und kollagenen Fasern des Bindegewebes führt, was die Haut vorzeitig altern läßt, und daß sie als Ursache zahlreicher photo-
toxischer und photoallergischer Reaktionen zu sehen ist. Der schädigende Einfluß der UVB-Strahlung kann durch UVA-Strahlung verstärkt werden.

10

Zum Schutz gegen die Strahlen des UVA-Bereichs werden daher gewisse Derivate des Dibenzoylmethans verwendet, deren Photostabilität (Int. J. Cosm. Science 10, 53 (1988)), nicht in ausreichendem Maße gegeben ist.

15

Die UV-Strahlung kann aber auch zu photochemischen Reaktionen führen, wobei dann die photochemischen Reaktionsprodukte in den Hautmetabolismus eingreifen.

20

Vorwiegend handelt es sich bei solchen photochemischen Reaktionsprodukten um radikalische Verbindungen, beispielsweise Hydroxyradikale. Auch undefinierte radikalische Photoprodukte, welche in der Haut selbst entstehen, können aufgrund ihrer hohen
Reaktivität unkontrollierte Folgereaktionen an den Tag legen. Aber auch Singulett-sauerstoff, ein nichtradikalischer angeregter Zustand des Sauerstoffmoleküls kann bei UV-
Bestrahlung auftreten, ebenso kurzlebige Epoxide und viele andere. Singulett-sauerstoff
beispielsweise zeichnet sich gegenüber dem normalerweise vorliegenden Triplett-sauerstoff (radikalischer Grundzustand) durch gesteigerte Reaktivität aus. Allerdings existie-
25 ren auch angeregte, reaktive (radikalische) Triplettzustände des Sauerstoffmoleküls.

25

30

Ferner zählt UV-Strahlung zur ionisierenden Strahlung. Es besteht also das Risiko, daß auch ionische Spezies bei UV-Exposition entstehen, welche dann ihrerseits oxidativ in
die biochemischen Prozesse einzugreifen vermögen.

Um diesen Reaktionen vorzubeugen, können den kosmetischen bzw. dermatologischen Formulierungen zusätzliche Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

Es ist bereits vorgeschlagen worden, Vitamin E, eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück.

5 Aufgabe der Erfindung war es daher, kosmetische, dermatologische und pharmazeutische Wirkstoffe und Zubereitungen sowie Lichtschutzformulierungen zu schaffen, die zur Prophylaxe und Behandlung lichtempfindlicher Haut, insbesondere von Photodermatosen, bevorzugt der polymorphen Lichtdermatose dienen.

10 Weitere Bezeichnungen für die polymorphe Lichtdermatose sind PLD, PLE, Mallorca-Akne und eine Vielzahl von weiteren Bezeichnungen, wie sie in der Literatur (z. B. A. Voelckel et al, Zentralblatt Haut- und Geschlechtskrankheiten (1989), 156, S.2), angegeben sind.

15 Hauptsächlich werden Antioxidantien als Schutzsubstanzen gegen den Verderb der sie enthaltenden Zubereitungen verwendet. Dennoch ist bekannt, daß auch in der menschlichen und tierischen Haut unerwünschte Oxidationsprozesse auftreten können.

Im Aufsatz "Skin Diseases Associated with Oxidative Injury" in "Oxidative Stress in Dermatology", S. 323 ff. (Marcel Decker Inc., New York, Basel, Hong Kong, Herausgeber: Jürgen Fuchs, Frankfurt, und Lester Packer, Berkeley/Californien), werden oxidative Schäden der Haut und ihre näheren Ursachen aufgeführt.

25 Auch aus dem Grunde, solchen Reaktionen vorzubeugen, können kosmetischen oder dermatologischen Formulierungen zusätzlich Antioxidantien und/oder Radikalfänger einverleibt werden.

30 Zwar sind einige Antioxidantien und Radikalfänger bekannt. So ist bereits in den US-Patentschriften 4,144,325 und 4,248,861 sowie aus zahlreichen anderen Dokumenten vorgeschlagen worden, Vitamin E, eine Substanz mit bekannter antioxidativer Wirkung in Lichtschutzformulierungen einzusetzen, dennoch bleibt auch hier die erzielte Wirkung weit hinter der erhofften zurück.

Weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, die Nachteile des Standes

der Technik zu vermeiden und insbesondere die durch Umwelttoxinen verursachten Schäden dauerhaft, nachhaltig und ohne das Risiko von Nebenwirkungen zu beheben bzw. ihnen vorzubeugen.

- 5 Es hat sich überraschenderweise herausgestellt, daß die
Verwendung von Substanzen gewählt aus der Gruppe:

10 Ipriflavin (7-Isopropoxy-Isoflavon), Formononetin (7-Hydroxy-4'-Methoxyiso-
flavon), Ononin (Formononetin-7-O- β -D-Glucopyranosid), 4'-Isopropyl-Isofla-
von, Mono-hydroxy-Isoflavone, Mono-hydroxy-Dihydro-Isoflavone, Mono-
hydroxy-Tetrahydro-Isoflavone, O-Desmethylangolensin, Dihydro-Daidzein (Di-
hydro-7,4'-Dihydroxy-Isoflavon), Tetrahydro-Daidzein (Tetrahydro-7,4'-Di-
hydroxy-Isoflavon), Dihydro-Genistein (Dihydro-5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavon), 2-
Dehydro-O-Desmethyl-Angolensin, Dehydroequol, 4-Hydroxy-7-Glucose-
Isoflavon und 5-Hydroxy-7,4'-Dimethoxy-Isoflavon

- 15 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung, Pflege und
Prophylaxe von sensibler Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der Symp-
tome einer negativen Veränderung der physiologischen Homeostase der gesunden
Haut.

den Nachteilen des Standes der Technik abhilft.

20

Bevorzugt enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen gemäß der Erfin-
dung 0,001 bis 10 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,01 bis 1 Gew.-%, an Isoflavonen,
bezogen auf die Gesamtzusammensetzung der Zubereitungen.

- 25 Bei Anwendung der erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffe bzw. kosmetischer oder
topischer dermatologischer Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungs-
gemäß verwendeten Wirkstoffen ist in überraschender Weise eine wirksame Behand-
lung, aber auch eine Prophylaxe von

- Veränderungen der normalen Lipidperoxidation,
- 30 • defizitären, sensitiven oder hypoaktiven Hautzuständen oder defizitären, sensitiven
oder hypoaktiven Zuständen von Hautanhangsgebilden,
- entzündlichen Hautzuständen,
- atopischem Ekzem, polymorpher Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo
- empfindlicher, juckender oder gereizter Haut,

- Veränderung des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der gesunden Haut,
- Veränderung des physiologischen transepidermalen Wasserverlustes,
- Verminderung der Hauthydratation und Abnahme des Feuchtigkeitsgehaltes der Haut,
- 5 • Veränderung des Natural Moisturizing Factor Gehaltes,
- Verminderung der Zell-Zell-Kommunikation,
- Mangelscheinungen der intrazellulären DNS-Synthese,
- DNS-Schädigungen und Verminderung von endogenen DNS-Reparaturmechanismen,
- 10 • Aktivierung von Metalloproteinasen und/oder anderer Proteasen bzw. Inhibierung der entsprechenden endogenen Inhibitoren dieser Enzyme,
- Abweichungen von den normalen post-translationalen Modifikationen von Bindegewebsbestandteilen,
- Veränderungen des normalen Hyaluronsäure- und Glycosaminoglycangehaltes der gesunden Haut,
- 15 • Schuppenbildung der Haare,
- Hautbrüchigkeit und Hautermüdung,
- Erhöhung der normalen Keratinozytenproliferation,
- Verminderung der natürlichen Regeneration und Struktur der Haare,
- 20 • umweltbedingten (durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale verursachten) negativen Veränderungen der Haut und der Hautanhangsgebilde möglich.

Es ist erfindungsgemäß insbesondere äußerst vorteilhaft, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. kosmetische oder topische dermatologische Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff zur kosmetischen oder dermatologischen Behandlung oder Prophylaxe unerwünschter Hautzustände zu verwenden.

30 Erfindungsgemäß können Zubereitungen, welche die erfindungsgemäßen Wirkstoffkombinationen enthalten, übliche Antioxidantien eingesetzt werden.

Vorteilhaft werden die Antioxidantien gewählt aus der Gruppe bestehend aus Aminosäuren (z. B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z. B. Uro-

caninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D,L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z. B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z. B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z. B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z. B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z. B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Buthioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z. B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z. B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z. B. Citronensäure, Milchsäure, Apfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren Derivate (z. B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Alanindiessigsäure, Flavonoide, Polyphenole, Catechine, Vitamin C und Derivate (z. B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z. B. Vitamin-E-acetat), sowie Koniferylbenzoat des Benzoëharzes, Rutinsäure und deren Derivate, Ferulasäure und deren Derivate, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretsäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Zink und dessen Derivate (z. B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z. B. Selenmethionin), Stilbene und deren Derivate (z. B. Stilbenoxid, Trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

25

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

30

Ferner kann es von Vorteil sein, die erfindungsgemäßen Wirkstoffe zu verkapseln, z. B. als sogenannte solid lipid nanoparts mit Hilfe von aufgeschmolzenen Wachsen, die unter anderem, aber nicht ausschließlich, gewählt sein können aus der Gruppe der Esterwachse, Triglyceridwachse oder Kohlenwasserstoffwachse. Weiterhin kann es von

Vorteil sein die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in Polymere zu verkapseln, z. B. in Partikel auf Basis hochvernetzter Polymethacrylate und/oder Cellulosetriacetate und/oder als Core/Shell-Partikel mit einer Hülle aus Poly(oxymethylurea), Nylon, Polyamide, Polyurethan, Polyester, Gelatine und Polyolefine.

5

Die Prophylaxe bzw. die kosmetische oder dermatologische Behandlung mit dem erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff bzw. mit den kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff erfolgt in der üblichen Weise, und zwar dergestalt, daß der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff bzw. die kosmetischen oder topischen dermatologischen Zubereitungen mit einem wirksamen Gehalt an erfindungsgemäß verwendetem Wirkstoff auf die betroffenen Hautstellen aufgetragen wird.

10

Vorteilhaft kann der erfindungsgemäß verwendete Wirkstoff eingearbeitet werden in übliche kosmetische und dermatologische Zubereitungen, welche in verschiedenen Formen vorliegen können. So können sie z. B. eine Lösung, eine Emulsion vom Typ Wasser-in-Öl (W/O) oder vom Typ Öl-in-Wasser (O/W), oder eine multiple Emulsionen, beispielsweise vom Typ Wasser-in-Öl-in-Wasser (W/O/W) oder Öl-in-Wasser-in-Öl (O/W/O), eine Hydrodispersion oder Lipodispersion, ein Gel, eine Pickering-Emulsion, einen festen Stift oder auch ein Aerosol darstellen.

15

20

Erfindungsgemäße Emulsionen im Sinne der vorliegenden Erfindung, z. B. in Form einer Crème, einer Lotion, einer kosmetischen Milch sind vorteilhaft und enthalten z. B. Fette, Öle, Wachse und/oder andere Fettkörper, sowie Wasser und einen oder mehrere Emulgatoren, wie sie üblicherweise für einen solchen Typ der Formulierung verwendet werden.

25

Es ist auch möglich und vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff in wäßrige Systeme bzw. Tensidzubereitungen zur Reinigung der Haut und der Haare einzufügen.

30

Es ist dem Fachmann natürlich bekannt, daß anspruchsvolle kosmetische Zusammensetzungen zumeist nicht ohne die üblichen Hilfs- und Zusatzstoffe denkbar sind. Darunter zählen beispielsweise Konsistenzgeber, Füllstoffe, Parfum, Farbstoffe, Emulgato-

ren, zusätzliche Wirkstoffe wie Vitamine oder Proteine, Lichtschutzmittel, Stabilisatoren, Insektenrepellentien, Alkohol, Wasser, Salze, antimikrobiell, proteolytisch oder keratolytisch wirksame Substanzen usw.

- 5 Mutatis mutandis gelten entsprechende Anforderungen an die Formulierung medizinischer Zubereitungen.

Medizinische topische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung enthalten in der Regel ein oder mehrere Medikamente in wirksamer Konzentration. Der
10 Einfachheit halber wird zur sauberen Unterscheidung zwischen kosmetischer und medizinischer Anwendung und entsprechenden Produkten auf die gesetzlichen Bestimmungen der Bundesrepublik Deutschland verwiesen (z. B. Kosmetikverordnung, Lebensmittel- und Arzneimittelgesetz).

- 15 Es ist dabei ebenfalls von Vorteil, den erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoff als Zusatzstoff zu Zubereitungen zu geben, die bereits andere Wirkstoffe für andere Zwecke enthalten.

Entsprechend können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, je nach ihrem Aufbau, beispielsweise verwendet werden als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Sonnenschutzlotion, Nähr-
20 crème, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

25 Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlicher Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescrèmes oder Makeup-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxi-
30 dantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

Dementsprechend enthalten die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorzugsweise neben einem oder mehreren erfindungsgemäß verwendeten Wirkstoffen zusätzlich mindestens eine weitere UV-A- und/oder UV-B-Filtersubstanz. Die Formulierungen können, obgleich nicht notwendig, gegebenenfalls auch ein oder mehrere organische und/oder anorganische Pigmente als UV-Filtersubstanzen enthalten, welche in der Wasser- und/oder der Ölphase vorliegen können.

Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwerlösliche oder unlösliche Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans (TiO_2), Zinks (ZnO), Eisens (z. B. Fe_2O_3), Zirkoniums (ZrO_2), Siliciums (SiO_2), Mangans (z. B. MnO), Aluminiums (Al_2O_3), Cers (z. B. Ce_2O_3), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden.

Solche Pigmente können im Sinne der vorliegenden Erfindung vorteilhaft oberflächlich behandelt („gecoatet“) sein, wobei beispielsweise ein amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophoben Schicht versehen werden.

Erfindungsgemäß vorteilhaft sind z. B. Titandioxidpigmente, die mit Octylsilanol beschichtet sind. Geeignete Titandioxidpartikel sind unter der Handelsbezeichnung T805 bei der Firma Degussa erhältlich. Besonders vorteilhaft sind ferner mit Aluminiumstearat beschichtete TiO_2 -Pigmente, z. B. die unter der Handelsbezeichnung MT 100 T bei der Firma TAYCA erhältlichen.

Eine weitere vorteilhafte Beschichtung der anorganischen Pigmente besteht aus Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicon), einem Gemisch vollmethylierter, linearer Siloxanpolymere, die endständig mit Trimethylsiloxy-Einheiten blockiert sind. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Zinkoxid-Pigmente, die auf diese Weise beschichtet werden.

Vorteilhaft ist ferner eine Beschichtung der anorganischen Pigmente mit einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan, insbesondere Dimethylpolysiloxan mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten, und Silicagel, welches auch als

Simethicone bezeichnet wird. Es ist insbesondere von Vorteil, wenn die anorganischen Pigmente zusätzlich mit Aluminiumhydroxid bzw. Aluminiumoxidhydrat (auch: Alumina, CAS-Nr.: 1333-84-2) beschichtet sind. Besonders vorteilhaft sind Titandioxide, die mit Simethicone und Alumina beschichtet sind, wobei die Beschichtung auch Wasser enthalten kann. Ein Beispiel hierfür ist das unter dem Handelsnamen Eusolex T2000 bei der Firma Merck erhältliche Titandioxid.

Vorteilhaftes organisches Pigment im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) [INCI: Bisoctyl-triazol], welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

Vorteilhaft enthalten erfindungsgemäße Zubereitungen Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, wobei die Gesamtmenge der Filtersubstanzen z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-% beträgt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

Weitere vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind die Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazol)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimidazylate, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliopan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist.

Ferner vorteilhaft sind das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und dessen Salze (besonders die entsprechenden 10-Sulfato-verbindungen, insbesondere das ent-

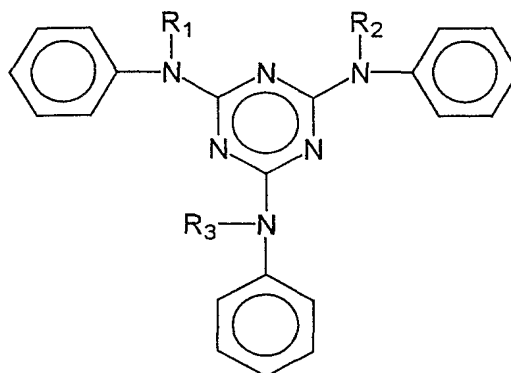
sprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird.

5 Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d.h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren.

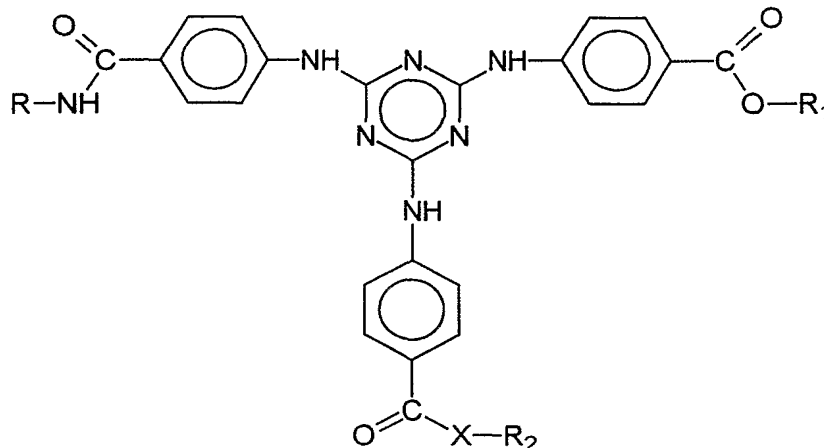
10 Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Bis-Resorcinyltriazinderivate. Insbesondere bevorzugt sind das 2,4-Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Aniso Triazin), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

15 Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten bevorzugt mehrere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Dibenzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan], Benzotriazolderivate [beispielsweise das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol)], Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und/oder ihre Salze, das 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol und/oder dessen Salze
20 und/oder das 2,4-Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander.

Auch andere UV-Filtersubstanzen, welche das Strukturmotiv



aufweisen, sind vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise die in der Europäischen Offenlegungsschrift EP 570 838 A1 beschriebenen s-Triazinderivate, deren chemische Struktur durch die generische Formel

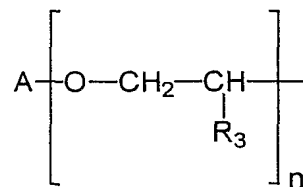


5 wiedergegeben wird, wobei

R einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄- Alkylgruppen, darstellt,

X ein Sauerstoffatom oder eine NH-Gruppe darstellt,

10 R₁ einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄- Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel



15 bedeutet, in welcher

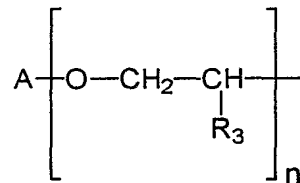
A einen verzweigten oder unverzweigten C₁-C₁₈-Alkylrest, einen C₅-C₁₂-Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C₁-C₄- Alkylgruppen,

R₃ ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

20 n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

R_2 einen verzweigten oder unverzweigten C_1 - C_{18} -Alkylrest, einen C_5 - C_{12} -Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C_1 - C_4 - Alkylgruppen, darstellt, wenn X die NH-Gruppe darstellt, und

5 einen verzweigten oder unverzweigten C_1 - C_{18} -Alkylrest, einen C_5 - C_{12} -Cycloalkylrest, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C_1 - C_4 - Alkylgruppen, oder ein Wasserstoffatom, ein Alkalimetallatom, eine Ammoniumgruppe oder eine Gruppe der Formel



bedeutet, in welcher

10 A einen verzweigten oder unverzweigten C_1 - C_{18} -Alkylrest, einen C_5 - C_{12} -Cycloalkyl- oder Arylrest darstellt, gegebenenfalls substituiert mit einer oder mehreren C_1 - C_4 - Alkylgruppen,

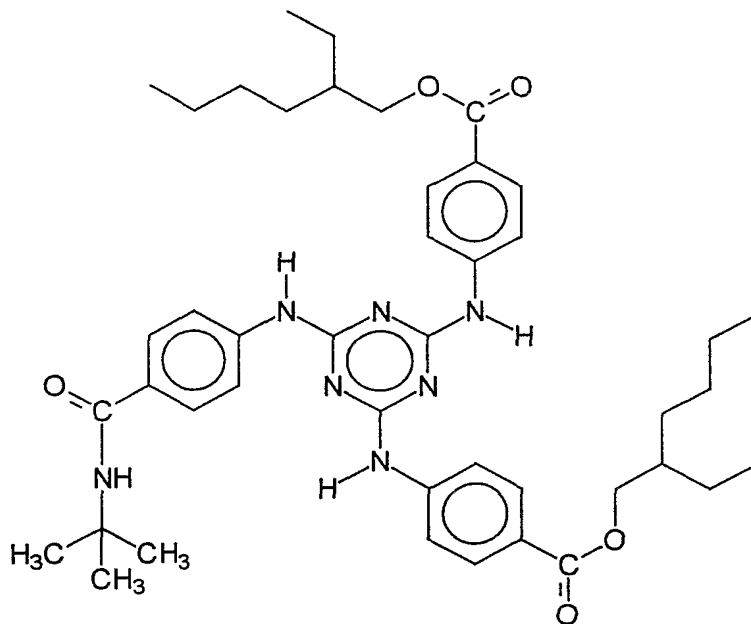
R_3 ein Wasserstoffatom oder eine Methylgruppe darstellt,

n eine Zahl von 1 bis 10 darstellt,

15 wenn X ein Sauerstoffatom darstellt.

Besonders bevorzugte UV-Filtersubstanz im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner ein unsymmetrisch substituiertes s-Triazin, dessen chemische Struktur durch die Formel

15



wiedergegeben wird, welches im Folgenden auch als Diethylbutylamidotriazin (INCI: Diethylbutamidotriazone) bezeichnet wird und unter der Handelsbezeichnung UVA-SORB HEB bei Sigma 3V erhältlich ist.

5

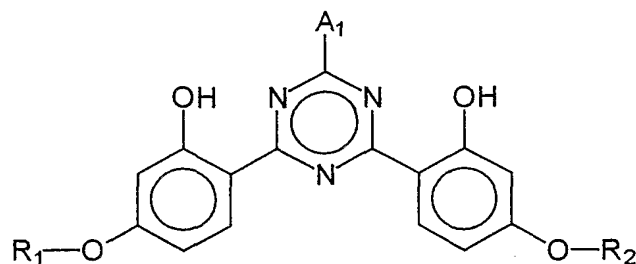
Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch ein symmetrisch substituiertes s-Triazin, das 4,4',4''-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltriimino)-tris-benzoësäure-tris(2-ethylhexylester), synonym: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazone), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung

10

Auch in der Europäischen Offenlegungsschrift 775 698 werden bevorzugt einzusetzende Bis-Resorcinyltriazinderivate beschrieben, deren chemische Struktur durch die gene-

15

rische Formel



wiedergegeben wird, wobei R_1 , R_2 und A_1 verschiedenste organische Reste repräsentieren.

Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner das 2,4-Bis-[[4-(3-sulfonato)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin Natriumsalz, das 2,4-Bis-[[4-(3-(2-Propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-methoxyethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(3-(2-propyloxy)-2-hydroxy-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-[4-(2-ethyl-carboxyl)-phenylamino]-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2-ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(1-methyl-pyrrol-2-yl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-tris(trimethylsiloxy-silylpropyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, das 2,4-Bis-[[4-(2"-methylpropenyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin und das 2,4-Bis-[[4-(1',1',1',3',5',5',5'-Heptamethylsiloxy-2"-methyl-propyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin.

Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bezeichnung Drometrizole Trisiloxane.

Die UV-B- und/oder Breitband-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Vorteilhafte öllösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoessäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoessäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoessäureamylester;
- 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin;
- Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzalmalonsäuredi(2-ethylhexyl)ester;

- Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)ester, 4-Methoxyzimtsäureisopentylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon
- 5 ▪ sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

Vorteilhafte wasserlösliche UV-B- und/oder Breitband-Filtersubstanzen sind z. B.:

- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz, sowie die Sulfonsäure selbst;
- 10 ▪ Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

15 Eine weitere erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

20 Es kann auch von erheblichem Vorteil sein, polymergebundene oder polymere UV-Filtersubstanzen in Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung zu verwenden, insbesondere solche, wie sie in der WO-A-92/20690 beschrieben werden.

25 Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, erfindungsgemäß weitere UV-A- und/oder UV-B-Filter in kosmetische oder dermatologische Zubereitungen einzuarbeiten, beispielsweise bestimmte Salicylsäurederivate wie 4-Isopropylbenzylsalicylat, 2-Ethylhexylsalicylat (= Octylsalicylat), Homomenthylsalicylat.

Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

30 Vorteilhaft enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen die Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, in einer Gesamtmenge von z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmeti-

sche Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen. Sie können auch als Sonnenschutzmittel fürs Haar oder die Haut dienen.

- 5 Die erfindungsgemäßen kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen können kosmetische Wirk-, Hilfs- und/oder Zusatzstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen verwendet werden, z. B. Antioxidationsmittel, Konservierungsmittel, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, oberflächenaktive Substanzen,
- 10 Emulgatoren, weichmachende, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikonderivate.
- 15 Sofern die kosmetische oder dermatologische Zubereitung im Sinne der vorliegenden Erfindung eine Lösung oder Emulsion oder Dispersion darstellt, können als Lösungsmittel verwendet werden:
- Wasser oder wäßrige Lösungen
 - Öle, wie Triglyceride der Caprin- oder der Caprylsäure, vorzugsweise aber Rizinusöl;
 - Fette, Wachse und andere natürliche und synthetische Fettkörper, vorzugsweise Ester von Fettsäuren mit Alkoholen niedriger C-Zahl, z. B. mit Isopropanol, Propylenglykol oder Glycerin, oder Ester von Fettalkoholen mit Alkansäuren niedriger C-Zahl oder mit Fettsäuren;
 - 25 • Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte.

30

Insbesondere werden Gemische der vorstehend genannten Lösungsmittel verwendet. Bei alkoholischen Lösungsmitteln kann Wasser ein weiterer Bestandteil sein.

Die Ölphase der Emulsionen, Oleogele bzw. Hydrodispersionen oder Lipodispersionen

im Sinne der vorliegenden Erfindung wird vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der Ester aus gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen, aus der Gruppe der Ester aus aromatischen Carbonsäuren und gesättigten und/oder ungesättigten, verzweigten und/oder unverzweigten Alkoholen einer Kettenlänge von 3 bis 30 C-Atomen. Solche Esteröle können dann vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Isopropylstearat, Isopropyloleat, n-Butylstearat, n-Hexyllaurat, n-Decyloleat, Isooctylstearat, Isononylstearat, Isononylisononanoat, 2-Ethylhexylpalmitat, 2-Ethylhexyllaurat, 2-Hexyldecylstearat, 2-Octyldodecylpalmitat, Oleyloleat, Oleylerucat, Erucyloleat, Erucylrucat sowie synthetische, halbsynthetische und natürliche Gemische solcher Ester, z. B. Jojobaöl.

Ferner kann die Ölphase vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Kohlenwasserstoffe und -wachse, der Silikonöle, der Dialkylether, der Gruppe der gesättigten oder ungesättigten, verzweigten oder unverzweigten Alkohole, sowie der Fettsäuretriglyceride, namentlich der Triglycerinester gesättigter und/oder ungesättigter, verzweigter und/oder unverzweigter Alkancarbonsäuren einer Kettenlänge von 8 bis 24, insbesondere 12 - 18 C-Atomen. Die Fettsäuretriglyceride können beispielsweise vorteilhaft gewählt werden aus der Gruppe der synthetischen, halbsynthetischen und natürlichen Öle, z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Palmkernöl und dergleichen mehr.

Auch beliebige Abmischungen solcher Öl- und Wachskomponenten sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung einzusetzen. Es kann auch gegebenenfalls vorteilhaft sein, Wachse, beispielsweise Cetylpalmitat, als alleinige Lipidkomponente der Ölphase einzusetzen.

Vorteilhaft wird die Ölphase gewählt aus der Gruppe 2-Ethylhexylisostearat, Octyldodecanol, Isotridecylisononanoat, Isoeicosan, 2-Ethylhexylcocoat, C₁₂₋₁₅-Alkylbenzoat, Capryl-Caprinsäure-triglycerid, Dicaprylylether.

Besonders vorteilhaft sind Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und 2-Ethylhexylisostearat, Mischungen aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat und Isotridecylisononanoat sowie Mischungen

aus C₁₂₋₁₅-Alkybenzoat, 2-Ethylhexylisostearat und Isotridecylisononanoat.

Von den Kohlenwasserstoffen sind Paraffinöl, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

5

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

10

Vorteilhaft wird Cyclomethicon (Octamethylcyclotetrasiloxan) als erfindungsgemäß zu verwendendes Silikonöl eingesetzt. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

15

Besonders vorteilhaft sind ferner Mischungen aus Cyclomethicon und Isotridecylisononanoat, aus Cyclomethicon und 2-Ethylhexylisostearat.

20

Die wäßrige Phase der erfindungsgemäßen Zubereitungen enthält gegebenenfalls vorteilhaft Alkohole, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl, sowie deren Ether, vorzugsweise Ethanol, Isopropanol, Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, ferner Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination.

25

30

Erfindungsgemäß verwendete Gele enthalten üblicherweise Alkohole niedriger C-Zahl, z. B. Ethanol, Isopropanol, 1,2-Propandiol, Glycerin und Wasser bzw. ein vorstehend genanntes Öl in Gegenwart eines Verdickungsmittels, das bei ölig-alkoholischen Gelen

vorzugsweise Siliciumdioxid oder ein Aluminiumsilikat, bei wäßrig-alkoholischen oder alkoholischen Gelen vorzugsweise ein Polyacrylat ist.

5 Feste Stifte enthalten z. B. natürliche oder synthetische Wachse, Fettalkohole oder Fettsäureester.

10 Übliche Grundstoffe, welche für die Verwendung als kosmetische Stifte im Sinne der vorliegenden Erfindung geeignet sind, sind flüssige Öle (z. B. Paraffinöle, Ricinusöl, Isopropylmyristat), halbfeste Bestandteile (z. B. Vaseline, Lanolin), feste Bestandteile (z. B. Bienenwachs, Ceresin und Mikrokristalline Wachse bzw. Ozokerit) sowie hochschmelzende Wachse (z. B. Carnaubawachs, Candelillawachs)

15 Als Treibmittel für aus Aerosolbehältern versprühbare kosmetische und/oder dermatologische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind die üblichen bekannten leichtflüchtigen, verflüssigten Treibmittel, beispielsweise Kohlenwasserstoffe (Propan, Butan, Isobutan) geeignet, die allein oder in Mischung miteinander eingesetzt werden können. Auch Druckluft ist vorteilhaft zu verwenden.

20 Natürlich weiß der Fachmann, daß es an sich nichttoxische Treibgase gibt, die grundsätzlich für die Verwirklichung der vorliegenden Erfindung in Form von Aerosolpräparaten geeignet wären, auf die aber dennoch wegen bedenklicher Wirkung auf die Umwelt oder sonstiger Begleitumstände verzichtet werden sollte, insbesondere Fluorkohlenwasserstoffe und Fluorchlorkohlenwasserstoffe (FCKW).

25 Kosmetische Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können auch als Gele vorliegen, die neben einem wirksamen Gehalt am erfindungsgemäßen Wirkstoff und dafür üblicherweise verwendeten Lösungsmitteln, bevorzugt Wasser, noch organische Verdickungsmittel, z. B. Gummiarabikum, Xanthangummi, Natriumalginat, Cellulose-Derivate, vorzugsweise Methylcellulose, Hydroxymethylcellulose, Hydroxyethylcellulose, 30 Hydroxypropylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder anorganische Verdickungsmittel, z. B. Aluminiumsilikate wie beispielsweise Bentonite, oder ein Gemisch aus Polyethylenglykol und Polyethylenglykolstearat oder -distearat, enthalten. Das Verdickungsmittel ist in dem Gel z. B. in einer Menge zwischen 0,1 und 30 Gew.-%, bevorzugt zwischen 0,5 und 15 Gew.-%, enthalten.

Es ist insbesondere vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, wenn die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen weitere Wirkstoffe enthalten, insbesondere natürliche Wirkstoffe und/oder deren Derivate, wie z. B. alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosylrutin, Carnitin, Carnosin, Osmolyte, Klee-Extrakt, Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt.

Der Gehalt dieser Wirkstoffe (eine oder mehrere Verbindungen) wird vorteilhaft aus dem Bereich von 0,0001 bis 30 Gew.-% gewählt, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, wobei unter „Isoflavone“ hier im Speziellen eine oder mehrere der folgenden Substanzen zu verstehen ist:

15 Ipriflavin (7-Isopropoxy-Isoflavin), Formononetin (7-Hydroxy-4'-Methoxyisoflavin), Ononin (Formononetin-7-O- β -D-Glucopyranosid), 4'-Isopropyl-Isoflavin, Mono-hydroxy-Isoflavone, Mono-hydroxy-Dihydro-Isoflavone, Mono-hydroxy-Tetrahydro-Isoflavone, O-Desmethylangolensin, Dihydro-Daidzein (Dihydro-7,4'-Dihydroxy-Isoflavin), Tetrahydro-Daidzein (Tetrahydro-7,4'-Dihydroxy-Isoflavin), Dihydro-Genistein (Dihydro-5,7,4'-Trihydroxy-Isoflavin), 2-Dehydro-O-Desmethyl-Angolensin, Dehydroequol, 4-Hydroxy-7-Glucose-Isoflavin und 5-Hydroxy-7,4'-Dimethoxy-Isoflavin

Beispiele:7. Beispiele O/W Cremes

	1	2	3	4	5
Glyceryl Stearate Citrate	4,00		2,00		2,00
Glycerylsterat SE		3,00			
PEG-40-Stearat	1,00				
Polyglyceryl-3-Methylglucose Distearat				3,00	
Sorbitan Stearate					2,00
Stearic Acid		1,00			
Stearyl Alcohol			5,00		
Cetyl Alcohol	3,00	2,00		3,00	
Cetylstearylalcohol					2,00
Caprylic/Capric Triglyceride	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Octyldodecanol			2,00		2,00
Dicaprylether		4,00		2,00	1,00
Mineral Oil	5,00	2,00		3,00	
TiO ₂			1,00		
4-Methylbenzylidene Camphor			1,00		
Butyl Methoxydibenzolymethane			0,50		
Isoflavonoide	0,20	0,50	0,10	1,00	0,30
Tococpherol	0,1				0,20
Biotin			0,05		
Trisodium EDTA	0,1		0,10	0,1	
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Carbomer	3,00	0,1		0,1	0,1
Natronlauge 45%	q.s	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	5,00	3,00	4,00	3,00	3,00
Butylene Glycol		3,00			
Parfuem	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Aqua	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

	6	7	8	9	10
Glyceryl Stearate Citrate		2,00	2,00		
GlycerylSterate SE	5,00				
Stearic Acid				2,50	3,50
Stearyl Alcohol	2,00				
Cetyl Alcohol				3,00	4,50
Cetylstearylalcohol		3,00	1,00		0,50
C12-15 Alkyl Benzoate		2,00	3,00		
Caprylic/Capric Triglyceride	2,00				
Octyldodecanol	2,00	2,00		4,00	6,00
Dicaprylether					
Mineral Oil		4,00	2,00		
Cyclomethicone				0,50	2,00
Dimethicone	2,00				
TiO ₂	2,00				
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00				1,00
Butyl Methoxydibenzolymethane	0,50				0,50
Isoflavonoide	0,20	0,70	0,25	2,00	0,40
Tococpherol					0,05
Trisodium EDTA			0,20		0,20
Konservierungsmittel	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Xanthan Gum			0,20		
Carbomer	0,15	0,1		0,05	0,05
Natronlauge 45%	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Glycerin	3,00		3,00	5,00	3,00
Butylene Glycol		3,00			
Alcohol Denat.		3,00		3,00	
Parfuem	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Aqua	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

2. Beispiele W/O Emulsionen

	1	2	3	4	5
Cetyldimethicone Copolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00				4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
Ethylhexyl Methoxycinnamate		8,00		5,00	4,00
Aniso Triazine	2,00	2,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethane			2,00	1,00	
Dioctyl Butamidotriazon	3,00	1,00			3,00
Ethylhexyl Triazone			3,00	4,00	
4-Methylbenzylidene Camphor		2,00		4,00	2,00
Octocrylene	7,00	2,50	4,00		2,50
Dioctylbutamidotriazone	1,00			2,00	
Bisimidazylate	1,00	2,00	0,50		
Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid	0,50			3,00	2,00
Titandioxid		2,00	1,50		3,00
Zinkoxid	3,00	1,00	2,00	0,50	
Mineralöl			10,0		8,00
C ₁₂₋₁₅ Alkyl Benzoate				9,00	
Dicaprylyl Ether	10,00				7,00
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate			2,00	8,00	4,00
Dicaprylyl Carbonate	5,00		6,00		
Dimethicone		4,00	1,00	5,00	
Cyclomethicone	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Butylene Glycol					
Octoxyglycerin		0,30	1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja		1,00	1,50		
MgSO ₄	1,00	0,50		0,50	
MgCl ₂			1,00		0,70

Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00
Isoflavonoide	0,10	0,60	1,50	1,00	0,80
Trisodium EDTA					
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Methylparaben	0,50		0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	0,60
Ethanol	3,00		1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

	6	7
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	4,00	5,00
Lanolin alcohol	0,50	1,50
Isohexadecane	1,00	2,00
Myristyl Myristate	0,50	1,50
Cera Microcristallina + Paraffinum Liquidum	1,00	2,00
Butyl Methoxydibenzoylmethane	0,50	1,50
4-Methylbenzylidene Camphor	1,00	3,00
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate	4,00	5,00
Shea Butter		0,50
Butylene Glycol		6,00
Octoxyglycerin		3,00
Glycerin	5,00	
Vitamin E Acetat	0,50	1,00
Isoflavonoide	0,20	0,25
Trisodium EDTA	0,20	0,20
Methylparaben	q.s.	q.s.
Phenoxyethanol	q.s.	q.s.
Ethanol		3,00
Parfum	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100

3. Beispiele Hydrodispersionen

	1	2	3	4	5
Ceteareth-20	1,00			0,5	
Cetyl Alkohol			1,00		
Sodium Carbomer		0,20		0,30	
Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylate Crosspolymer	0,50		0,40	0,10	0,10
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
Ethylhexyl Methoxycinnamate				5,00	8,00
Aniso Triazine		1,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethane	1,00		2,00		
Dioctyl Butamidotriazon		2,00		2,00	1,00
Ethylhexyl Triazone	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzylidene Camphor	4,00	4,00			2,00
Octocrylene		4,00	4,00		2,50
Dioctylbutamidotriazone	1,00			2,00	
Bisimidazylate	1,00		0,50		2,00
Phenylbenzimidazole Sulfonic Acid	0,50			3,00	
Titandioxid	0,50		2,00	3,00	1,00
Zinkoxid	0,50	1,00	3,00		2,00
C ₁₂₋₁₅ Alkyl Benzoate	2,00	2,50			
Dicaprylyl Ether		4,00			
Butylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylyl Carbonate		2,00	6,00		
Dimethicone		0,50	1,00		
Phenyltrimethicone	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
PVP Hexadecene Copolymer	0,50			0,50	1,00
Octoxyglycerin			1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja			1,50		
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00
Isoflavonoide	0,15	0,60	1,50	1,00	0,80

DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Koncyl - L ®	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Methylparaben	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Phenoxyethanol	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Ethanol	3,00	2,00	1,50		1,00
Parfum	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

4. Beispiel (Gelcreme):

		Massengehalt (%)
	Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylate	0,40
	Crosspolymer	
5	Carbomer	0,20
	Xanthan Gum	0,10
	Cetearyl Alkohol	3,00
	C ₁₂₋₁₅ Alkyl Benzoate	4,00
	Caprylic/Capric Triglyceride	3,00
10	Cyclometicone	5,00
	Dimeticone	1,00
	Isoflavonoide	0,20
	Glycerin	3,00
	Natriumhydroxid	q.s.
15	Konservierung	q.s.
	Parfum	q.s.
	Wasser, demineralisiert	ad 100,0
	pH-Wert eingestellt auf 6,0	

20

Beispiel (W/O-Creme)

	Lameform TGI	3,50
	Glycerin	3,00
	Dehymuls PGPH	3,50
25	Isoflavonoide	0,50
	Konservierungsmittel	q.s.
	Parfum	q.s.
	Magnesiumsulfat	0,6
	Isopropyl Stearate	2,0
30	Caprylyl Ether	8,0
	Cetearyl Isononanoate	6,0
	Wasser, demin.	ad 100,0

Beispiel (W/O/W-Creme):

		Massengehalt (%)
5	Glyceryl Stearate	3,00
	PEG-100 Stearate	0,75
	Behenylalkohol	2,00
	Caprylic/Capric Triglyceride	8,0
	Octyldodecanol	5,00
10	C12-15 Alkyl Benzoate	3,00
	Isoflavonoide	1,00
	Magnesium Sulfat (MgSO ₄)	0,80
	EDTA	0,10
	Konservierung	q.s.
15	Parfum	q.s.
	Wasser, demineralisiert	ad 100,0
	pH-Wert eingestellt auf 6,0	

Patentansprüche:

1. Verwendung von Substanzen gewählt aus der Gruppe:

5 Ipriflavin (7-Isopropoxy-Isoflavin), Formononetin (7-Hydroxy-4'-Methoxy-
 isoflavin), Ononin (Formononetin-7-O- β -D-Glucopyranosid), 4'-Isopropyl-
 Isoflavin, Mono-hydroxy-Isoflavone, Mono-hydroxy-Dihydro-Isoflavone,
 Mono-hydroxy-Tetrahydro-Isoflavone, O-Desmethylangolensin, Dihydro-
 Daidzein (Dihydro-7,4'-Dihydroxy-Isoflavin), Tetrahydro-Daidzein (Tetra-
 10 hydro-7,4'-Dihydroxy-Isoflavin), Dihydro-Genistein (Dihydro-5,7,4'-Tri-
 hydroxy-Isoflavin), 2-Dehydro-O-Desmethyl-Angolensin, Dehydroequol, 4-
 Hydroxy-7-Glucose-Isoflavin und 5-Hydroxy-7,4'-Dimethoxy-Isoflavin
 in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen zur Behandlung, Pflege und
 Prophylaxe von sensibler Haut und/oder zur Behandlung und Prophylaxe der
 Symptome einer negativen Veränderung der physiologischen Homeostase der ge-
 15 sunden Haut.

2. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die Hautschäden und/oder negativen Hautzu-
stände ein oder mehrere Erscheinungsbilder aus der folgenden Gruppe darstellen:

- Veränderungen der normalen Lipidperoxidation,
- 20 • defizitäre, sensitive oder hypoaktive Hautzustände oder defizitäre, sensitive
oder hypoaktive Zustände von Hautanhangsgebilden,
- entzündliche Hautzuständen,
- atopisches Ekzem, polymorphe Lichtdermatose, Psoriasis, Vitiligo,
- empfindliche, juckende oder gereizte Haut,
- 25 • Veränderung des Ceramid-, Lipid- und Energiestoffwechsels der gesunden
Haut,
- Veränderung des physiologischen transepidermalen Wasserverlustes,
- Verminderung der Hauthydratation und Abnahme des Feuchtigkeitsgehaltes
der Haut,
- 30 • Veränderung des Natural Moisturizing Factor Gehaltes,
- Verminderung der Zell-Zell-Kommunikation,
- Mangelerscheinungen der intrazellulären DNS-Synthese,
- DNS-Schädigungen und Verminderung von endogenen DNS-Reparaturmecha-

nismen,

- Aktivierung von Metalloproteinasen und/oder anderer Proteasen bzw. Inhibierung der entsprechenden endogenen Inhibitoren dieser Enzyme,
- Abweichungen von den normalen post-translationalen Modifikationen von Bindegewebsbestandteilen,
- Veränderungen des normalen Hyaluronsäure- und Glycosaminoglycangehaltes der gesunden Haut,
- Schuppenbildung der Haare,
- Hautbrüchigkeit und Hautermüdung,
- Erhöhung der normalen Keratinozytenproliferation,
- Verminderung der natürlichen Regeneration der Haare,
- umweltbedingte (durch Rauchen, Smog, reaktive Sauerstoffspezies, freie Radikale oder dergleichen verursachte) negative Veränderungen der Haut und der Hautanhangsgebilde.

3. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Isoflavonen (eine oder mehrere Verbindungen) in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,0005 bis 50,0 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20,0 Gew.-%, gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

4. Verwendung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an Isoflavonen (eine oder mehrere Verbindungen) in den kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen aus dem Bereich von 0,02 bis 10,0 Gew.-%, bevorzugt von 0,02 bis 5,0 Gew.-%, besonders vorteilhaft von 0,5 bis 3,0 Gew.-%, gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zusammensetzung.

5. Verwendung nach Anspruch 1, wobei die kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen sich durch einen zusätzlichen Gehalt an einem oder mehreren der folgenden natürlichen Wirkstoffe und/oder deren Derivaten auszeichnen: alpha-Liponsäure, Phytoen, D-Biotin, Coenzym Q10, alpha Glucosylrutin, Carnitin, Carnosin, Osmolyte, Klee-Extrakt, Hopfen- bzw. Hopfen-Malz-Extrakt.